

论文

可逆性胆碱酯酶抑制剂:N,N-二甲胺基甲酸-5-(1,3,3-三取代二氢吲(口茛))酯的合成

张松山;纪庆娥

军事医学科学院药理毒理研究所,北京

摘要:

为了进一步研究胺甲酸酯类胆碱酯酶抑制剂的化学结构与胆碱酯酶抑制作用间的关系,在催醒宁的化学结构基础上合成了9个N,N-二甲胺基甲酸-5-二氢吲哚酯化合物。化合物 I ~ V 的pI₅₀ 值在6.72以上,其中 II (R=C₄H₉)的pI₅₀ 值高达8.26,较催醒宁(R=CH₃)高一个数量级。在这些化合物的合成过程中,成功地应用了相转移催化反应于2-二氢吲哚酮的N-烷化及5-羟基-二氢吲哚的胺甲酰化。

关键词: 胆碱酯酶抑制剂 相转移催化 胺甲酸二氢吲哚酯

SYNTHESIS OF 5-(1,3,3-TRISUBSTITUTED) INDOLINYL-N,N-DIMETHYLCARBAMATES AS REVERSIBLE CHOLINESTERASE INHIBITORS

ZHANG Song-Shan and JI Qing-E

Abstract:

In order to study the structure-activity relationship of cholinesterase inhibitor-carbamates, nine 5-indoliny N,N-dimethylcarbamates have been synthesized as anticholinesterase agents. All compounds tested are strong cholinesterase inhibitors. The pI₅₀ of compound II a (R=C₄H₉) is 8.26, more potent than CUI XING NING (R=CH₃). For synthesizing these compounds, the technique of phase transfer catalysis was successfully applied in the N-alkylation of oxindoles and the carbamylation of 5-hydroxyindolines.

Keywords: 5-(1,3,3-Trisubstituted) indoliny N, N-dimethyl-carbamate Phase transfer catalysis Anticholinesterase

收稿日期 1986-02-01 修回日期 网络版发布日期

DOI:

基金项目:

通讯作者:

作者简介:

参考文献:

本刊中的类似文章

1. 祝勇;童心玥;赵玥;陈卉;姜凤超.乙酰胆碱酯酶抑制剂药效团模型的构建[J]. 药学报, 2008,43(3): 267-276
2. 崔太安;丁振闯.可逆性胆碱酯酶抑制剂的研究:2-氧化-1,3,2-二氧磷杂环己烷类化合物的合成[J]. 药学报, 1987,22(11): 827-832
3. 王斌;何煦昌;白东鲁.老年痴呆症药物石杉碱甲类似物研究V.光学活性(-)-1-甲基石杉碱甲的合成[J]. 药学报, 1999,34(6): 434-438
4. 张百芳;彭芳芳;章江洲;武栋成.乙酰胆碱酯酶抑制剂他克林和多奈哌齐抗星形孢菌素致凋亡作用的比较[J]. 药学报, 2002,37(2): 98-102
5. 靳广毅;瑕瑜;白东鲁.基于双中心理论的乙酰胆碱酯酶抑制剂研究进展[J]. 药学报, 2002,37(9): 749-752
6. 何煦昌;于更立;白东鲁;(-)-14-去甲基石杉碱甲的不对称全合成及其乙酰胆碱酯酶抑制活性老年痴呆症药物石杉碱甲类似物研究VI.(-)-14-去甲基石杉碱甲的不对称全合成及其乙酰胆碱酯酶抑制活性[J]. 药学报, 2003,38(5): 346-349
7. 王林;董永明.可逆性胆碱酯酶抑制剂二甲氨基甲酸-[3-(烷氨基)烷氧基-4(5)-叔丁基]苯酯的合成[J]. 药学报, 1988,23(3): 213-217

扩展功能

本文信息

- Supporting info
- PDF(298KB)
- [HTML全文]
- 参考文献

服务与反馈

- 把本文推荐给朋友
- 加入我的书架
- 加入引用管理器
- 引用本文
- Email Alert
- 文章反馈
- 浏览反馈信息

本文关键词相关文章

- 胆碱酯酶抑制剂
- 相转移催化
- 胺甲酸二氢吲哚酯

本文作者相关文章

- 张松山
- 纪庆娥

PubMed

- Article by
- Article by

8. 赵明;黄如衡.催醒宁在大鼠离体灌流肝脏中的生物转化[J]. 药学学报, 1990,25(11): 801-806
9. 王明亮;纪庆娥.二氢吡啶类化合物的合成及其抑酶活性[J]. 药学学报, 1991,26(2): 103-110
10. 徐振荣;何煦昌;白东鲁.石杉碱甲类似物的研究II. *N*-甲基吡啶酮石杉碱甲类似物的合成[J]. 药学学报, 1996,31(5): 364-370
11. 徐振荣;何煦昌;白东鲁.老年痴呆症药物石杉碱甲的类似物研究 II (±)-失二碳石杉碱甲类似物的合成[J]. 药学学报, 1996,31(4): 258-266
12. 李桦;阮金秀;汤炳生;武力民;贾敬山.催醒安在大鼠尿内代谢产物的研究[J]. 药学学报, 1989,24(4): 246-250
13. 董永明;高企秀;甄润芬.可逆性胆碱酯酶抑制剂 II.二甲氨基甲酸间-(烷基)烷硫基苯酯的合成[J]. 药学学报, 1984,19(5): 394-396
14. 董永明;马建洲;甄润芬.可逆性胆碱酯酶抑制剂:二甲氨基甲酸-[3-烷基-4-(烷基)烷氧基]苯酯的合成[J]. 药学学报, 1984,19(7): 538-540
15. 姚霞君;董永明.可逆性胆碱酯酶抑制剂:二甲氨基甲酸-[2-(2-二甲氨基)乙氧基-4(或5)-特丁基]苯酯的合成[J]. 药学学报, 1984,19(8): 622-625
16. 胡水根;董永明;张其楷.可逆性胆碱酯酶抑制剂:二甲氨基甲酸-5-(1,3,3-三甲基-6-取代基)吡啶满酯的合成[J]. 药学学报, 1984,19(8): 626-629
17. 孟八一;纪庆娥.可逆性胆碱酯酶抑制剂——*N,N*-二甲氨基甲酸5-(1,2-取代苯吡啶)酯的合成[J]. 药学学报, 1983,18(12): 905-911

文章评论 (请注意:本站实行文责自负, 请不要发表与学术无关的内容!评论内容不代表本站观点.)

反馈人	<input style="width: 95%;" type="text"/>	邮箱地址	<input style="width: 95%;" type="text"/>
反馈标题	<input style="width: 95%;" type="text"/>	验证码	<input style="width: 40%;" type="text"/> 3578